

特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕

| | | |
|--|--------------------------------------|---------------------------|
| 出願人又は代理人 の書類記号 A41530M | 今後の手続きについては、様式PCT/ IPEA/ 416を参照すること。 | |
| 国際出願番号 PCT/JP2004/010558 | 国際出願日 (日.月.年) 16.07.2004 | 優先日 (日.月.年) 16.07.2003 |
| 国際特許分類 (IPC) Int.Cl. ⁷ A61K31/167, A61P17/00, A61P35/00 | | |
| 出願人 (氏名又は名称) 株式会社医薬分子設計研究所 | | |

- この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。
- この報告には次の附属物件も添付されている。
 - ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）
☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
 - ☐ 電子媒体は全部で _____ （電子媒体の種類、数を示す）。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☐ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☒ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

| | | | |
|--|------------------------------|----|------|
| 国際予備審査の請求書を受理した日 16.07.2004 | 国際予備審査報告を作成した日 04.08.2005 | | |
| 名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号 | 特許庁審査官 (権限のある職員) 八原 由美子 | 4C | 3437 |
| | 電話番号 03-3581-1101 内線 3452 | | |

様式PCT/ IPEA/ 409 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第Ⅴ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

| | | | |
|----------------|-------|------|---|
| 新規性 (N) | 請求の範囲 | 6-16 | 有 |
| | 請求の範囲 | 1-5 | 無 |
| 進歩性 (IS) | 請求の範囲 | | 有 |
| | 請求の範囲 | 1-16 | 無 |
| 産業上の利用可能性 (IA) | 請求の範囲 | 1-16 | 有 |
| | 請求の範囲 | | 無 |

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献1 : US 2003/0083386 A1 (Yuan, J.) 2003.05.01

文献2 : WO 02/076926 A1 (SCHERING CORPORATION) 2002.10.03

文献3 : WO 02/067919 A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION) 2002.09.06

文献4 : JP 11-21225 A (田辺製薬株式会社) 1999.01.26

文献5 : WO 02/49632 A1 (株式会社医薬分子設計研究所) 2002.06.27

文献6 : BERKING, C., et al. Am. J. Pathol., 2001, 158(3), pp.943-953

文献7 : SINGH, R.K., et al. Histol. Histopathol., 2000, 15, pp.843-849

○請求の範囲1-5について

文献1の請求項6、Fig.3、文献2の請求項35、実施例34-37及び40にはそれぞれ、本願明細書の一般式(I)で示される化合物に相当する化合物がメラノーマの治療に用いられることが記載されている。

文献3の第1頁第20-26行目及びBIOLOGICAL EXAMPLESの項には、本願明細書の一般式(I)で示される化合物に相当する化合物がメラノーマ増殖刺激活性を有するGro- α の受容体への結合を阻害することが記載されている。

文献4の試験例1には、本願明細書の一般式(I)で示される化合物に相当する化合物がメラニン生成を抑制することが記載されている。

してみれば、請求の範囲1-5に係る発明は、文献1-4に対して新規性及び進歩性を有さない。

○請求の範囲1-16について

文献5の請求項13には、TNF- α 、IL-1、IL-8の発現を抑制する、本願明細書の一般式(I)で示される化合物に相当する化合物が記載されており、請求の範囲1-16に係る発明は、該化合物が色素沈着及び／又は皮膚癌の予防及び／又
(続葉に続く。)

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則 70.10)

| 出願番号 特許番号 | 公知日 (日. 月. 年) | 出願日 (日. 月. 年) | 優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年) |
|----------------------------|------------------|------------------|--|
| WO 03/103655 A1 「E X」 | 18. 12. 2003 | 05. 06. 2003 | 10. 06. 2002 |
| WO 2004/006906 A2 「E X」 | 22. 01. 2004 | 15. 07. 2003 | 15. 07. 2002 02. 08. 2002 03. 04. 2003 |

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則 70.9)

| 書面による開示以外の開示の種類 | 書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年) | 書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年) |
|-----------------|------------------------------|--|
|-----------------|------------------------------|--|

第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1-9 及び 11-16 について

請求の範囲 1-9, 11-16 には、請求の範囲 1 の式 (I) で表される化合物を有効成分として含有する医薬について記載されている。

しかし、式 (I) で表わされる化合物に共通の化学構造は化合物全体のごく僅かにすぎず、具体的化合物を特定し得ないほどに不明確な、互いの構造が著しく異なる多数の化合物群がこれに包含されるところ、明細書の記載をみても、一の化合物におけるメラノサイト増殖抑制試験が確認されているのみであるから、かかる明細書の記載によっては、式 (I) により表される他の化合物が一律に被試験化合物と同様の作用を有するものとは認められない。

したがって、かかる請求の範囲及び明細書の記載によっては、明細書で具体的な作用が確認されている化合物と同等の化学構造を有するものと認められる、請求の範囲 10 に係る発明及びこれに相当する部分以外の発明に関しては、当該技術分野の専門家が当該発明を実施することができる程度に明確かつ十分な裏付けがなされたものとも認められない。

また、請求の範囲 14 及び 15 では具体的な有効成分となる化合物を文献番号により特定するよう記載されているが、本願請求の範囲及び明細書の記載に基づいてはいかなる化合物がこれに該当するのかが全く判断できないため、かかる記載によってはこれらの請求の範囲に係る 発明が明確かつ簡潔に記載されたものということとはできず、また、これを引用する請求の範囲 16 についても同様である。

そして、本願はこのような発明が十分に開示されたものではないため、国際予備審査報告の作成にあたっては、明細書において開示された発明の範囲からみて合理的な範囲内をその対象とした。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V.2 欄の続き

は治療に用いられる点で、前者に相違する。

しかしながら、文献6の第943頁右欄第4-32行目及び文献7の第845頁左欄第38-47行目にはそれぞれ、TNF- α 、IL-1、IL-8の発現がメラノーマの増殖・発達・形質変化を引き起こすことが記載されている。

してみれば、文献5に記載された、本願明細書の一般式(I)で示される化合物に相当する化合物を、TNF- α 、IL-1、IL-8の発現を抑制することによって皮膚癌であるメラノーマの予防及び／又は治療に用い、請求項1-16に係る発明とすることは、当該技術分野の専門家にとって自明である。

してみれば、請求の範囲1-16に係る発明は、文献5-7に対して進歩性を有さない。